

(12) DEMANDE INTERNATIONALE PUBLIÉE EN VERTU DU TRAITÉ DE COOPÉRATION  
EN MATIÈRE DE BREVETS (PCT)

(19) Organisation Mondiale de la Propriété  
Intellectuelle  
Bureau international



(43) Date de la publication internationale  
17 juillet 2003 (17.07.2003)

PCT

(10) Numéro de publication internationale  
WO 03/057697 A1

(51) Classification internationale des brevets<sup>7</sup> :  
C07D 471/08, A61K 31/439, A61P  
25/00 // (C07D) 471/08, 221:00, 209:00

(21) Numéro de la demande internationale :  
PCT/FR03/00004

(22) Date de dépôt international : 3 janvier 2003 (03.01.2003)

(25) Langue de dépôt : français

(26) Langue de publication : français

(30) Données relatives à la priorité :  
02/00109 7 janvier 2002 (07.01.2002) FR

(81) États désignés (*national*) : AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NO, NZ, OM, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

(84) États désignés (*régional*) : brevet ARIPO (GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), brevet eurasien (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), brevet européen (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE, SI, SK, TR), brevet OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

(71) Déposant (*pour tous les États désignés sauf US*) :  
SANOFI-SYNTHELABO [FR/FR]; 174, avenue de  
France, F-75013 Paris (FR).

(72) Inventeurs; et

(75) Inventeurs/Déposants (*pour US seulement*) : GALLI,  
Frédéric [FR/FR]; 6, avenue de Rueil, F-92420 Vaucres-  
son (FR). LECLERC, Odile [FR/FR]; 11, rue Winston  
Churchill, F-91300 Massy (FR). LOCHEAD, Alistair  
[GB/FR]; 95, rue de Paris, F-94220 Charenton le Pont  
(FR).

(74) Mandataire : LUDWIG, Jacques; Sanofi-Synthelabo,  
174, avenue de France, F-75013 Paris (FR).

Publiée :

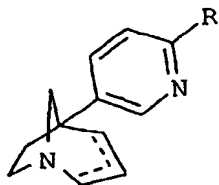
- avec rapport de recherche internationale
- avant l'expiration du délai prévu pour la modification des revendications, sera republiée si des modifications sont reçues

En ce qui concerne les codes à deux lettres et autres abréviations, se référer aux "Notes explicatives relatives aux codes et abréviations" figurant au début de chaque numéro ordinaire de la Gazette du PCT.

(54) Title: DERIVATIVES OF 5-(PYRIDIN-3-YL)-1-AZABICYCLO[3.2.1]OCTANE, THE PREPARATION THEREOF AND THE APPLICATION OF SAME IN THERAPEUTICS

(54) Titre : DERIVES DE 5-(PYRIDIN-3-YL)-1-AZABICYCLO [3.2.1] OCTANE, LEUR PREPARATION ET LEUR APPLICATION EN THERAPEUTIQUE

WO 03/057697 A1



(I)

(57) Abstract: The invention relates to compounds having general formula (I), wherein R denotes a halogen atom, a phenyl group which is substituted by one or more groups selected from among halogen atoms and the (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) alkoxy, nitro, amino, trifluoromethyl, cyano, hydroxy, acetyl or methylenedioxy groups, a pyridinyl group, a thienyl group, a indolyl group, or a pyrimidinyl group which is optionally substituted by one or more (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) alkoxy groups. Moreover, among the two carbon-carbon bonds denoted by ---, one is simple and the other can be simple or double. The inventive compounds are nicotinic receptor ligands.

(57) Abrégé : Composés répondant à la formule générale (I) dans laquelle R représente soit un atome d'halogène ou un groupe phényle substitué par un ou plusieurs groupes choisis parmi les atomes d'halogènes et les groupes (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyle, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy, nitro, amino, trifluorométhyle, cyano, hydroxy, acétyle ou méthylènedioxy, soit un groupe pyridinyle, soit un groupe thiényle, soit un groupe indolyle, ou un groupe pyrimidinyle éventuellement substitué par un ou plusieurs groupes (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy, sachant que, parmi les deux liaisons carbone-carbone représentées par ---, l'une est simple et l'autre peut être simple ou double. Les composés de l'invention sont des ligands pour les récepteurs nicotiniques.

## INTERNATIONAL SEARCH REPORT

National Application No  
PCT/FR 03/00004

## A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

IPC 7 C07D471/08 A61K31/439 A61P25/00 //(C07D471/08, 221:00,  
209:00)

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

## B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

IPC 7 C07D A61K A61P

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practical, search terms used)

EPO-Internal, WPI Data, CHEM ABS Data

## C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	US 5 817 679 A (SHEN ET AL.) 6 October 1998 (1998-10-06) example 87	1, 3
A	WO 00 34279 A (SANOFI SYNTHELABO) 15 June 2000 (2000-06-15) page 15, line 5 - line 10; claim 1	1, 3
A	WO 00 34284 A (SANOFI SYNTHELABO) 15 June 2000 (2000-06-15) page 18, line 8 - line 12; claim 1	1, 3

☐ Further documents are listed in the continuation of box C.☒ Patent family members are listed in annex.

## \* Special categories of cited documents:

- \*A\* document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance
- \*E\* earlier document but published on or after the international filing date
- \*L\* document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)
- \*O\* document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means
- \*P\* document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

- \*T\* later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention
- \*X\* document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone
- \*Y\* document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art.
- \*G\* document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search

14 April 2003

Date of mailing of the international search report

06/05/2003

Name and mailing address of the ISA

European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2  
NL - 2280 HV Rijswijk  
Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl,  
Fax: (+31-70) 340-3016

Authorized officer

Alfaro Faus, I

# INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International Application No

PCT/FR 03/00004

Patent document cited in search report		Publication date	Patent family member(s)	Publication date
US 5817679	A	06-10-1998	AU 708112 B2	29-07-1999
			AU 3540695 A	14-03-1996
			CA 2196979 A1	29-02-1996
			CN 1163613 A ,B	29-10-1997
			EP 0778835 A1	18-06-1997
			HU 77938 A2	30-11-1998
			JP 2002504883 T	12-02-2002
			US 6255490 B1	03-07-2001
			WO 9606093 A1	29-02-1996
			AU 695682 B2	20-08-1998
			AU 6497194 A	24-10-1994
			CA 2159723 A1	13-10-1994
			CN 1133045 A ,B	09-10-1996
			EP 0691971 A1	17-01-1996
			HU 74380 A2	30-12-1996
			JP 8511768 T	10-12-1996
			WO 9422868 A1	13-10-1994
			US 6060473 A	09-05-2000
WO 0034279	A	15-06-2000	FR 2786770 A1	09-06-2000
			AU 1393000 A	26-06-2000
			EP 1135389 A1	26-09-2001
			WO 0034279 A1	15-06-2000
			JP 2002531565 T	24-09-2002
			US 6407095 B1	18-06-2002
WO 0034284	A	15-06-2000	FR 2786769 A1	09-06-2000
			AU 1392900 A	26-06-2000
			EP 1144413 A1	17-10-2001
			WO 0034284 A1	15-06-2000
			JP 2002531568 T	24-09-2002